PCT

VELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM Internationales Büro

INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation 7:		(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 00/11032
C07K 14/655	A3	(43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 2. März 2000 (02.03.00)
(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP (22) Internationales Anmeldedatum: 20. August 1999 ((30) Prioritätsdaten: PCT/EP98/05306 20. August 1998 (20.08.98) (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): GEN PHARMA GESELLSCHAFT FÜR BIOTE OGISCHE FORSCHUNG, ENTWICKLUNG UN DUKTION MBH [DE/DE]; Czernyring 22, D-69 delberg (DE). (72) Erfinder; und (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): BRAUM, Günther Jakobsgasse 1, D-69214 Eppelheim (DE). LIFFER [DE/DE]; Keplerstrasse 23, D-69207 Sandhaus BIRR, Christian [DE/DE]; Bahnhofstrasse 130, Neckargemünd (DE). (74) Anwälte: WEICKMANN, H. usw.; Kopernikuss D-81679 München (DE).	20.08.9 CORPECHNO DO PR DI15 H DE/DI TH, Assen (D) D-691	(81) Bestimmungsstaaten: AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW, ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG). Veröffentlicht Mit internationalem Recherchenbericht. (88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenrichts: 14. September 2000 (14.09.00)
(54) Title: METHOD FOR PRODUCING BIOSTATIN (TT-232 TRIACETATE) AND ANALOGS THEREOF		

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON BIOSTATIN (TT-232 TRIACETAT) UND SEINE ANALOGA

(57) Abstract

The invention relates to a method for synthesising biostatin (TT 232) by means of solid phase synthesis on a polymer support, by gradually building up the peptide using amino acids derivatized with protective groups. According to said method, the protective groups are split off and the peptide is detached from the solid phase. The disulphide bond is closed through the oxidation of the completely or partially built up peptide in the presence of a suitable solvent for as long as the peptide remains bound to the solid phase. The invention also relates to a method for synthesising biostatin (TT232) by means of peptide synthesis in solution.

(57) Zusammenfassung

Die Erfindung betrifft ein Verfahren zur Synthese von Biostatin (TT-232) mittels Festphasensynthese an einem polymeren Träger durch stufenweisen Aufbau des Peptids unter Verwendung von mit Schutzgruppen derivatisierten Aminosäuren, wonach die Schutzgruppen abgespalten und das Peptid von der Festphase abgelöst wird, wobei die Disulfidbrücke durch Oxidation des vollständig oder teilweise aufgebauten Peptids in Gegenwart eines geeigneten Lösungsmittels geschlossen wird solange das Peptid noch an die feste Phase gebunden vorliegt. Die Erfindung betrifft weiter ein Verfahren zur Synthese von Biostatin (TT-232) mittels Peptidsynthese in Lösung.

BEST AVAILABLE COPY

